

AP

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2003年2月27日 (27.02.2003)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 03/016266 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07C 235/80, 237/42, 311/46, 317/40, C07D 213/30, 213/68, 213/75, 215/12, 215/38, 231/12, 233/64, 239/26, 241/12, 249/08, 257/04, 261/08, 263/14, 271/10, 277/24, 277/46, 295/18, 295/22, 307/81, 317/66, 401/12, 403/12, 417/12

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/08211

(22) 国際出願日: 2002年8月12日 (12.08.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2001-247346 2001年8月16日 (16.08.2001) JP  
特願2001-372066 2001年12月5日 (05.12.2001) JP  
特願2002-151232 2002年5月24日 (24.05.2002) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 日本たばこ産業株式会社 (JAPAN TOBACCO INC.) [JP/JP]; 〒105-8422 東京都港区虎ノ門二丁目2番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および  
(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 加藤晋 (KATOH, Susumu) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市紫町

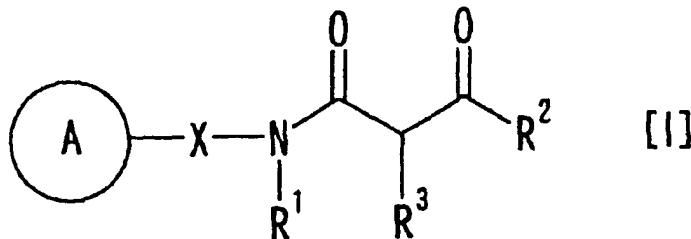
(1番 1号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 宮崎 将 (MIYAZAKI, Susumu) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 羽深 典之 (HABUKA, Noriyuki) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府高槻市紫町1番1号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 高島一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒541-0044 大阪府大阪市中央区伏見町四丁目2番14号 藤村大和生命ビル Osaka (JP).

(81) 指定国(国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国(広域): ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI特

[統葉有]

(54) Title:  $\beta$ -KETOAMIDE COMPOUNDS AND MEDICINAL USE THEREOF(54) 発明の名称:  $\beta$ -ケトアミド化合物及びその医薬用途

(57) Abstract:  $\beta$ -Ketoamide compounds represented by the following general formula [I]: [I] wherein each symbol is as defined in the description; pharmaceutically acceptable salts thereof and anti-HIV agents containing these compounds. Because of having an HIV integrase inhibitory activity, the above compounds are useful as anti-HIV agents to be used in remedies or preventives for AIDS. Further efficacious anti-HIV agents can be obtained by combining the compounds with other anti-HIV agents such as a protease inhibitor or a reverse transcriptase inhibitor. Because of showing a specifically high inhibitory activity on integrase, these compounds are usable as safe drugs with little side effects on the human body.

[統葉有]

WO 03/016266 A1